

Translation

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY  
(Chapter II of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Article 36 and Rule 70)

PCT/JP2004/000074



Rec'd PCT/PTO 27 JUN 2005

Applicant's or agent's file reference 664167	FOR FURTHER ACTION See Form PCT/IPEA/416	
International application No. PCT/JP2004/000074	International filing date (day/month/year) 08 January 2004 (08.01.2004)	Priority date (day/month/year) 09 January 2003 (09.01.2003)
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC C07D 491/048, 213/75, A61K 31/444, 31/4545, 31/4985, 31/5377, 31/4355, A61P 7/02, 9/00, 9/10, 43/00		
Applicant TANABE SEIYAKU CO., LTD.		

- This report is the international preliminary examination report, established by this International Preliminary Examining Authority under Article 35 and transmitted to the applicant according to Article 36.
- This REPORT consists of a total of 6 sheets, including this cover sheet.
- This report is also accompanied by ANNEXES, comprising:
  - ☐ (sent to the applicant and to the International Bureau) a total of \_\_\_\_\_ sheets, as follows:
    - ☐ sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis of this report and/or sheets containing rectifications authorized by this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions).
    - ☐ sheets which supersede earlier sheets, but which this Authority considers contain an amendment that goes beyond the disclosure in the international application as filed, as indicated in item 4 of Box No. I and the Supplemental Box.
  - ☐ (sent to the International Bureau only) a total of \_\_\_\_\_, containing a sequence listing and/or tables related thereto, in computer readable form only, as indicated in the Supplemental Box Relating to Sequence Listing (see Section 802 of the Administrative Instructions).
- This report contains indications relating to the following items:
 

<input checked="" type="checkbox"/> Box No. I	Basis of the report
<input type="checkbox"/> Box No. II	Priority
<input checked="" type="checkbox"/> Box No. III	Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability
<input type="checkbox"/> Box No. IV	Lack of unity of invention
<input checked="" type="checkbox"/> Box No. V	Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement
<input checked="" type="checkbox"/> Box No. VI	Certain documents cited
<input type="checkbox"/> Box No. VII	Certain defects in the international application
<input type="checkbox"/> Box No. VIII	Certain observations on the international application

Date of submission of the demand 08 January 2004 (08.01.2004)	Date of completion of this report 06 December 2004 (06.12.2004)
Name and mailing address of the IPEA/JP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.

PCT/JP2004/000074

Box No. I Basis of the report

1. With regard to the language, this report is based on:

- ☐ the international application in the language in which it was filed
- ☐ the translation of the international application into \_\_\_\_\_, which is the language of a translation furnished for the purposes of:
- ☐ international search (Rule 12.3(a) and 23.1(b))
- ☐ publication of the international application (Rule 12.4(a))
- ☐ international preliminary examination (Rule 55.2(a) and/or 55.3(a))

2. With regard to the elements of the international application, this report is based on *(replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report)*:

- ☒ the international application as originally filed/furnished
- ☐ the description:
- pages \_\_\_\_\_ as originally filed/furnished
- pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_
- pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_
- ☐ the claims:
- pages \_\_\_\_\_ as originally filed/furnished
- pages\* \_\_\_\_\_ as amended (together with any statement) under Article 19
- pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_
- pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_
- ☐ the drawings:
- pages \_\_\_\_\_ as originally filed/furnished
- pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_
- pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_
- ☐ a sequence listing and/or any related table(s) – see Supplemental Box Relating to Sequence Listing.

3. ☐ The amendments have resulted in the cancellation of:

- ☐ the description, pages \_\_\_\_\_
- ☐ the claims, Nos. \_\_\_\_\_
- ☐ the drawings, sheets/figs \_\_\_\_\_
- ☐ the sequence listing *(specify)*: \_\_\_\_\_
- ☐ any table(s) related to sequence listing *(specify)*: \_\_\_\_\_

4. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments annexed to this report and listed below had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).

- ☐ the description, pages \_\_\_\_\_
- ☐ the claims, Nos. \_\_\_\_\_
- ☐ the drawings, sheets/figs \_\_\_\_\_
- ☐ the sequence listing *(specify)*: \_\_\_\_\_
- ☐ any table(s) related to sequence listing *(specify)*: \_\_\_\_\_

\* If item 4 applies, some or all of those sheets may be marked "superseded."

## INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.

PCT/JP2004/000074

## Box No. III Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability

The questions whether the claimed invention appears to be novel, to involve an inventive step (to be non obvious), or to be industrially applicable have not been examined in respect of:

- ☐ the entire international application  
☒ claims, Nos. 25-27

because:

- ☐ the said international application, or said claims Nos. \_\_\_\_\_  
relate to the following subject matter which does not require an international preliminary examination (*specify*):

- ☐ the description, claims or drawings (*indicate particular elements below*) or said claims Nos. \_\_\_\_\_  
are so unclear that no meaningful opinion could be formed (*specify*):

- ☐ the claims, or said claims Nos. \_\_\_\_\_ are so inadequately supported  
by the description that no meaningful opinion could be formed (*specify*):

- ☒ no international search report has been established for said claims Nos. 25-27
- ☐ a meaningful opinion could not be formed without the sequence listing; the applicant did not, within the prescribed time limit:
- ☐ furnish a sequence listing on paper complying with the standard provided for in Annex C of the Administrative Instructions, and such listing was not available to the International Preliminary Examining Authority in a form and manner acceptable to it.
  - ☐ furnish a sequence listing in electronic form complying with the standard provided for in Annex C of the Administrative Instructions, and such listing was not available to the International Preliminary Examining Authority in a form and manner acceptable to it.
  - ☐ pay the required late furnishing fee for the furnishing of a sequence listing in response to an invitation under Rules 13ter.1(a) or (b) and 13ter.2.
- ☐ a meaningful opinion could not be formed without the tables related to the sequence listings; the applicant did not, within the prescribed time limit, furnish such tables in electronic form complying with the technical requirements provided for in Annex C-bis of the Administrative Instructions, and such tables were not available to the International Preliminary Examining Authority in a form and manner acceptable to it.
- ☐ the tables related to the nucleotide and/or amino acid sequence listing, if in electronic form only, do not comply with the technical requirements provided for in Annex C-bis of the Administrative Instructions.
- ☐ See Supplemental Box for further details.

## INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.

PCT/JP2004/000074

Box No. V Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

## 1. Statement

Novelty (N)	Claims	1-24	YES
	Claims		NO
Inventive step (IS)	Claims		YES
	Claims	1-24	NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1-24	YES
	Claims		NO

## 2. Citations and explanations (Rule 70.7)

Document 1 (WO 95/33720 A1 (Green Cross Corp.), 14 December 1995) discloses a compound represented by general formula (I) (see original IPRP2 for formula), wherein

M is N,  
L is O,  
U is =N-,  
R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> are hydrogen, amino groups or the like,  
A is (1) (see original IPRP2 for formula) or (2) (see original IPRP2 for formula),  
B is (3) (see original IPRP2 for formula) wherein W is =CH-, =N-, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> are hydrogen or the like and  
D is (i) (see original IPRP2 for formula) wherein Q is O, S, N; p, r are 0, 1; q is 0, 1, 2, 3 (wherein when p is 1, one of either q or r is not 0).

## Claims 1-24

The inventions set forth in claims 1-24 do not involve an inventive step in the light of document 1 cited in the international search report.

When the activity of a certain compound in a certain field is known, it is common practice to keep the main skeleton of said compound as it is, to synthesise

## INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.

PCT/JP2004/000074

Box No. V

Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability;  
citations and explanations supporting such statement

compounds in which its substituent groups are changed and to investigate the activity of such compounds. Moreover, it is common practice to protect free amino groups with acyl groups. There would be no particular creative ability require in modifying the substituent groups of the ring in the compound disclosed in document 1, in protecting the amino groups binding to the ring with acyl groups, thereby producing a new compound. Therefore, the compounds set forth in the present application fall within the scope of such compounds set forth in document 1.

## INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.

PCT/JP2004/000074

## Box No. VI Certain documents cited

## 1. Certain published documents (Rule 70.10)

Application No. Patent No.	Publication date (day/month/year)	Filing date (day/month/year)	Priority date (valid claim) (day/month/year)
WO 03/82847 A1 (Tanabe Seiyaku Co., Ltd.)	09.10.2003	27.03.2003	28.03.2002

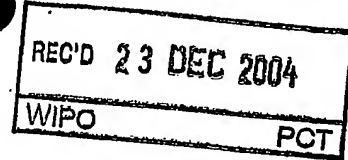
## 2. Non-written disclosures (Rule 70.9)

Kind of non-written disclosure	Date of non-written disclosure (day/month/year)	Date of written disclosure referring to non-written disclosure (day/month/year)
--------------------------------	--	---

Rec'd PCT/PTO 27 JUN 2005

特 許 協 力 条 約

PCT



特許性に関する国際予備報告（特許協力条約第二章）

（法第12条、法施行規則第56条）  
〔PCT36条及びPCT規則70〕

出願人又は代理人 の書類記号 664167	今後の手続きについては、様式PCT/IPEA/416を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JP2004/000074	国際出願日 (日.月.年) 08.01.2004	優先日 (日.月.年) 09.01.2003
国際特許分類 (IPC) Int. Cl <sup>7</sup> C07D491/048, 213/75, A61K31/444, 31/4545, 31/4985, 31/5377, 31/4355, A61P7/02, 9/00, 9/10, 43/00		
出願人 (氏名又は名称) 田辺製薬株式会社		

1. この報告書は、PCT35条に基づきこの国際予備審査機関で作成された国際予備審査報告である。 法施行規則第57条（PCT36条）の規定に従い送付する。	
2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で <u>5</u> ページからなる。	
3. この報告には次の附属物件も添付されている。	
a	<input type="checkbox"/> 附属書類は全部で _____ ページである。
	<input type="checkbox"/> 補正されて、この報告の基礎とされた及び/又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範囲及び/又は図面の用紙（PCT規則70.16及び実施細則第607号参照）
	<input type="checkbox"/> 第I欄4.及び補充欄に示したように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとのこの国際予備審査機関が認定した差替え用紙
b	<input type="checkbox"/> 電子媒体は全部で _____ (電子媒体の種類、数を示す)。 配列表に関する補充欄に示すように、コンピュータ読み取り可能な形式による配列表又は配列表に関連するテーブルを含む。（実施細則第802号参照）
4. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。	
<input checked="" type="checkbox"/>	第I欄 国際予備審査報告の基礎
<input type="checkbox"/>	第II欄 優先権
<input checked="" type="checkbox"/>	第III欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成
<input type="checkbox"/>	第IV欄 発明の単一性の欠如
<input checked="" type="checkbox"/>	第V欄 PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明
<input checked="" type="checkbox"/>	第VI欄 ある種の引用文献
<input type="checkbox"/>	第VII欄 国際出願の不備
<input type="checkbox"/>	第VIII欄 国際出願に対する意見

国際予備審査の請求書を受理した日 08.01.2004	国際予備審査報告を作成した日 06.12.2004	
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員)  渡辺 仁	4 P 8213
電話番号 03-3581-1101 内線 3490		

様式PCT/IPEA/409 (表紙) (2004年1月)

## 第I欄 報告の基礎

1. この国際予備審査報告は、下記に示す場合を除くほか、国際出願の言語を基礎とした。

- ☐ この報告は、\_\_\_\_\_語による翻訳文を基礎とした。  
それは、次の目的で提出された翻訳文の言語である。
- ☐ PCT規則12.3及び23.1(b)にいう国際調査
- ☐ PCT規則12.4にいう国際公開
- ☐ PCT規則55.2又は55.3にいう国際予備審査

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に応答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)

☒ 出願時の国際出願書類

☐ 明細書

第 \_\_\_\_\_ ページ、出願時に提出されたもの  
第 \_\_\_\_\_ ページ\*、 \_\_\_\_\_ 付けて国際予備審査機関が受理したもの  
第 \_\_\_\_\_ ページ\*、 \_\_\_\_\_ 付けて国際予備審査機関が受理したもの

☐ 請求の範囲

第 \_\_\_\_\_ 項、出願時に提出されたもの  
第 \_\_\_\_\_ 項\*、PCT19条の規定に基づき補正されたもの  
第 \_\_\_\_\_ 項\*、 \_\_\_\_\_ 付けて国際予備審査機関が受理したもの  
第 \_\_\_\_\_ 項\*、 \_\_\_\_\_ 付けて国際予備審査機関が受理したもの

☐ 図面

第 \_\_\_\_\_ ページ/図、出願時に提出されたもの  
第 \_\_\_\_\_ ページ/図\*、 \_\_\_\_\_ 付けて国際予備審査機関が受理したもの  
第 \_\_\_\_\_ ページ/図\*、 \_\_\_\_\_ 付けて国際予備審査機関が受理したもの

☐ 配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3. ☐ 補正により、下記の書類が削除された。

☐ 明細書 第 \_\_\_\_\_ ページ  
☐ 請求の範囲 第 \_\_\_\_\_ 項  
☐ 図面 第 \_\_\_\_\_ ページ/図  
☐ 配列表(具体的に記載すること) \_\_\_\_\_  
☐ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること) \_\_\_\_\_

4. ☐ この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c))

☐ 明細書 第 \_\_\_\_\_ ページ  
☐ 請求の範囲 第 \_\_\_\_\_ 項  
☐ 図面 第 \_\_\_\_\_ ページ/図  
☐ 配列表(具体的に記載すること) \_\_\_\_\_  
☐ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること) \_\_\_\_\_

\* 4. に該当する場合、その用紙に“superseded”と記入されることがある。

## 第Ⅲ欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解の不作成

1. 次に関して、当該請求の範囲に記載されている発明の新規性、進歩性又は産業上の利用可能性につき、次の理由により審査しない。

☐ 国際出願全体

☒ 請求の範囲 25-27

理由:

☐ この国際出願又は請求の範囲 \_\_\_\_\_ は、国際予備審査をすることを要しない  
次の事項を内容としている（具体的に記載すること）。

☐ 明細書、請求の範囲若しくは図面（次に示す部分）又は請求の範囲 \_\_\_\_\_ の  
記載が、不明確であるため、見解を示すことができない（具体的に記載すること）。

☐ 全部の請求の範囲又は請求の範囲 \_\_\_\_\_ が、明細書による十分な  
裏付けを欠くため、見解を示すことができない。

☒ 請求の範囲 25-27 \_\_\_\_\_ について、国際調査報告が作成されていない。

☐ ヌクレオチド又はアミノ酸の配列表が、実施細則の附属書C（塩基配列又はアミノ酸配列を含む明細書等の作成のためのガイドライン）に定める基準を、次の点で満たしていない。

書面による配列表が

コンピュータ読み取り可能な形式による配列表が

- |                          |                |
|--------------------------|----------------|
| <input type="checkbox"/> | 提出されていない。      |
| <input type="checkbox"/> | 所定の基準を満たしていない。 |
| <input type="checkbox"/> | 提出されていない。      |
| <input type="checkbox"/> | 所定の基準を満たしていない。 |

☐ コンピュータ読み取り可能な形式によるヌクレオチド又はアミノ酸の配列表に関連するテーブルが、実施細則の附属書Cの2に定める技術的な要件を、次の点で満たしていない。

- |                          |                    |
|--------------------------|--------------------|
| <input type="checkbox"/> | 提出されていない。          |
| <input type="checkbox"/> | 所定の技術的な要件を満たしていない。 |

☐ 詳細については補充欄を参照すること。

第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条(PCT35条(2))に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

## 1. 見解

新規性(N)

請求の範囲 1-24

請求の範囲

有  
無

進歩性(IS)

請求の範囲

請求の範囲 1-24

有  
無

産業上の利用可能性(IA)

請求の範囲

請求の範囲 1-24

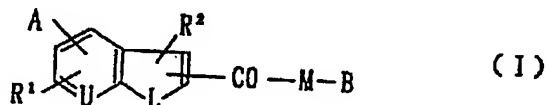
有  
無

## 2. 文献及び説明(PCT規則70.7)

文献1: WO 95/33720 A1 (株式会社ミドリ十字) 1995.12.14

一般  
る。

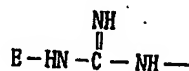
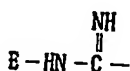
式 の化合物が記載されてい



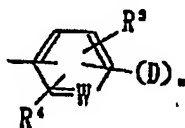
ここ

M: N, L: O, U: =N-, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>: 水素、アミノ基など

A

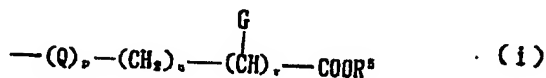


B



: W: =CH-, =N-  
R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>: 水素など

D



: Q: O, S, N

p, r: 0, 1

q: 0, 1, 2, 3 (pが1の時には、q, rの少なくとも一方は0でない)

\*請求の範囲: 1-24

請求の範囲第1項~第24項に記載の発明は、国際調査報告で引用された文献1により進歩性を有しない。

当該技術分野では、ある化合物の活性が知られていた場合に、その化合物の基本骨格はそのままにして、その置換基を替えた化合物を合成し、その活性を検討することは極めて普通に行われていることである。また、フリーのアミノ基をアシル基で保護することも普通に行われることである。文献1に記載の化合物において、環の置換基を改変したり、環別結合するアミノ基をアシル基で保護することにより、新たな化合物を製造することに格別の創意を認めることができないところ、本国際出願に係る化合物はそのような化合物と重複するものである。

## 第VI欄 ある種の引用文献

## 1. ある種の公表された文書 (PCT規則70.10)

出願番号 特許番号	公知日 (日. 月. 年)	出願日 (日. 月. 年)	優先日 (有効な優先権の主張) (日. 月. 年)
WO 03/82847 A1 (田辺製薬株式会社) EX	09. 10. 2003	27. 03. 2003	28. 03. 2002

## 2. 書面による開示以外の開示 (PCT規則70.9)

書面による開示以外の開示の種類	書面による開示以外の開示の日付 (日. 月. 年)	書面による開示以外の開示に言及している 書面の日付 (日. 月. 年)
-----------------	------------------------------	--